

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 03-161435

(43)Date of publication of application : 11.07.1991

(51)Int.Cl.

A61K 9/70

(21)Application number : 01-301303

(71)Applicant : LION CORP

(22)Date of filing : 20.11.1989

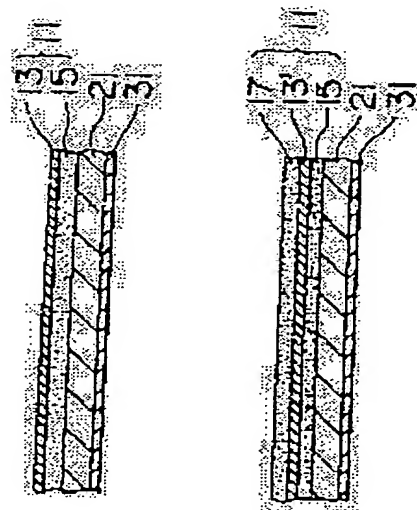
(72)Inventor : IIDA NORIO
YANAGIBASHI NORIO
TOMINAGA ANRI
HAYASHI HIROYUKI

(54) CATAPLASM

(57)Abstract:

PURPOSE: To provide a cataplasm made up of a substrate and a hydrous ointment, improved in both effectiveness and tackiness as well as application feeling, using such a substrate with a specified moisture permeability as to consist of a sheet form with polymer films and porous sheets integrated.

CONSTITUTION: The objective cataplasm made up of (A) a substrate 11 and (B) a hydrous ointment 21. The substrate consists of a sheet form produced by integrally laminating polymer films 13, 13' and porous sheets 15, 17 made of e.g. nonwoven fabric, woven fabric, knitted fabric, being 100-4000 (pref. 1000-3000) kg/m²/24hr in moisture permeability determined in accordance with the JIS general test method [moisture permeability test method for moisture-proof packaging materials (cut test)] condition A. The present cataplasm is improved in skin irritability and the oiliness after debonding and enhanced in ointment tackiness and the migration of active ingredients to the skin with the transpiration of the water contained suppressed.



LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision]

of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's
decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

2/2

⑨ 日本国特許庁(JP)

⑩ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

平3-161435

⑮ Int.Cl.³

A 61 K 9/70

識別記号

3 0 4

庁内整理番号

7624-4C

⑬ 公開 平成3年(1991)7月11日

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全5頁)

⑭ 発明の名称 貼付剤

⑯ 特 願 平1-301303

⑰ 出 願 平1(1989)11月20日

⑱ 発 明 者 飯 田 教 雄 神奈川県小田原市南鴨宮1-5-11 グリーンパーク天野201
⑱ 発 明 者 柳 橋 憲 夫 神奈川県中郡二宮町二宮87-16
⑱ 発 明 者 富 永 安 里 千葉県船橋市上山町3-579-43
⑱ 発 明 者 林 博 幸 神奈川県平塚市龍城ヶ丘6-35-307
⑲ 出 願 人 ライオン株式会社 東京都墨田区本所1丁目3番7号
⑳ 代 理 人 弁理士 白村 文男

明 細 書

1. 発明の名称

貼 付 剤

2. 特許請求の範囲

1. 支持体部と含水性膏体部とを有する貼付剤において、支持体部が高分子フィルムと多孔性シートとが一体化されたシート状体からなり、この支持体部の透湿度がJIS一般試験法「防湿包装材料の透湿度試験法(カップ法)」条件Aで試験するとき100～4000g/m²/24hrであることを特徴とする貼付剤。

3. 発明の詳細な説明

産業上の利用分野

本発明は、含水性膏体を用いた貼付剤に関する。

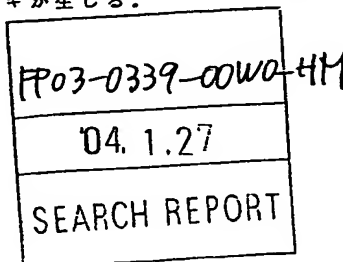
従来の技術

従来、含水性膏体を用いる貼付剤においては、支持体として不織布、織布等の透湿性の極めて高い素材が用いられてきた。しかしながら、含水性の膏体は、30～60%が水であるため、皮膚

へ貼付後の水分の蒸散により、膏体が硬化し、有効成分の皮膚への移行性の低下、粘着力の低下が問題であった。

一方、支持体の透湿性を極めて低くすることにより有効成分の皮膚への移行を高める手法は、ODT療法と呼ばれ既に公知であり、ステロイド剤を非水系基材に配合し、密封性の高い(透湿性の低い)高分子フィルムに展延した製剤が用いられている。しかしながら、このステロイド系製剤は、有効成分の皮膚への移行は高いものの、皮膚刺激性の点で問題があった。

含水ゲル基材を30μm程度の厚さの透湿性の低い高分子フィルム(ポリエチレン等)に展延した場合においては、膏体中の水分の蒸散がほぼ完全に抑えられるとともに、生体中の水分も加わり膏体が“むれた”状態となる。その結果、非水系基材を用いた場合と同様に有効成分の皮膚移行性は高まるが、一方において皮膚刺激性も高まりかゆみ、カブレの原因となったり、剥離後の皮膚へのベタツキが生じる。



発明が解決しようとする課題

本発明は、含水性膏体を用いた貼付剤において、皮膚刺激性および剥離後の皮膚へのベタツキを抑えて、しかも、有効性と粘着性を向上することを目的とする。

発明の構成

本発明の貼付剤は、支持体部と含水性膏体部とを有する貼付剤において、支持体部が高分子フィルムと多孔性シートとが一体化されたシート状体からなり、この支持体部のJIS一般試験法「防湿包装材料の透湿度試験法(カップ法)」(JIS Z 0208-1976)の条件Aにより測定したとき透湿度が $100\sim 4000\text{g}/\text{m}^2/24\text{hr}$ 、好ましくは $1000\sim 3000\text{g}/\text{m}^2/24\text{hr}$ の範囲にあることを特徴とする。

この透湿度が $100\text{g}/\text{m}^2/24\text{hr}$ 未満であると、皮膚刺激性や剥離後の皮膚のベタツキが問題となる。一方、 $4000\text{g}/\text{m}^2/24\text{hr}$ を超えると、水分の蒸散により膏体が硬化して粘着性が低下したり、有効成分の吸収性が低下する。

を得ることも可能である。第2図は、この層構成を示す断面図であり、高分子フィルム13'を不織布15,17でサンドイッチ状に挟んで熱融着した支持体11に、含水性膏体層21が塗工され、ライナー31が被覆されている。

高分子フィルム13'としては、ポリエチレン、エチレン-酢酸ビニル共重合体、ポリプロピレン等の $5\sim 15\mu\text{m}$ 程度の厚さのフィルムが好適である。

多孔性支持体15,17として用いる不織布としては、ポリエステル、レーヨン、ナイロン、ポリオレフィン、ポリエチレン等の繊維を用い、ニードルパンチ法、スパンレース法、スパンボンド法、ステッチボンド法、メルトブローン法等で製造したものが挙げられる。

用いられる含水性膏体は特に限定されないが、ボールタック法粘着力が $\text{No.}4$ 以上、好ましくは $\text{No.}10$ 以上のものを用いることにより、粘着力の低下を防止できるという本発明の特徴を生かし、使用性の良好な貼付剤が得られる。

このような支持体の一例としては、透湿度が $100\sim 4000\text{g}/\text{m}^2/24\text{hr}$ の範囲にある高分子フィルム、例えば透湿度が $2000\text{g}/\text{m}^2/24\text{hr}$ 前後のポリウレタン系フィルムと、従来から用いられている不織布、織布、綿布等の繊維集合体などの透湿度の大きな多孔性シートとを、熱融着、接着剤による接着などで積層一体化したものを挙げることができる。また、多孔性シートに高分子フィルム溶液を塗布して、その場で高分子フィルムを積層一体化することもできる。第1図はこの層構成を示す断面図であり、高分子フィルム13と不織布15とが積層一体化された支持体11に、含水性膏体層21が塗工され、ライナー31が被覆されている。

また、透湿度が小さい(例えば $100\text{g}/\text{m}^2/24\text{hr}$ 未満)の高分子フィルムを用いて、この高分子フィルムと不織布、織布、綿布等の多孔性シートとの積層一体化を熱融着により行なうことにより、高分子フィルムに繊維等の一部がくいついて細孔があき、適度な透湿度を有する支持体

このような基材の一例として、ポリアクリル酸とポリアクリル酸塩を重量比で $9/1\sim 1/9$ で配合したものが挙げられる。ポリアクリル酸の重量が上記範囲より少ないと肌への十分な粘着力が得られず、一方、ポリアクリル酸塩の配合量が少ないと十分な増粘が実現できず、“裏じみ”が起こりやすい。また、ポリアクリル酸とポリアクリル酸塩とは合計で $1\sim 20$ 重量%、好ましくは $3\sim 10$ 重量%となるように含水性膏体中に配合することが望ましい。合計配合量が、1重量%未満であると“裏じみ”の原因となり、一方、20重量%より多いと製造時の作業性が低下する。

ポリアクリル酸としては、分子量10万～600万のものが適当である。10万未満であると粘度が不足し“裏じみ”を起こしやすく、また、十分な粘着力を得ることができない。一方、600万を超えると粘度が高すぎ、展延、練合等の作業性が低下する。

ポリアクリル酸塩としては、ナトリウム塩、カリウム塩、アンモニウム塩等があり、特にナ

トリウム塩は入手しやすい原料である。また、ポリアクリル酸塩の中和度は50%以上が好ましく、それ未満の中和度では十分な粘度が得られず、“裏じみ”が起こりやすい。

ポリアクリル酸塩の分子量は10万～600万が適当である。10万未満であると粘度が不足して“裏じみ”を起こしやすく、また、十分な粘着力を得ることができない。一方、600万を超えると粘度が高すぎて展延、練合等の作業性が低下する。

発明の効果

本発明では、含水系膏体を用いた貼付剤において、100～4000g/㎡/24hrの適度な透湿度を有する支持体を用いることにより、皮膚刺激性の低減および剥離後のベタつき防止を可能にして使用感に優れ、しかも、水分の蒸散を抑えて膏体の粘着性および有効成分の皮膚への移行を改善することができる。

を1㎡当たり900gの割合で展延し、貼付剤(6cm×8cm)を得た。

実施例 2

2.0デニールのポリオレフィンのウェブを用いてスパンレース法によりシート状体として得た不織布(30g/㎡)と、1.0デニールのレーヨンのウェブをニードルパンチして得た不織布(50g/㎡)とを使用し、押出機(エクストルダ)から溶融した8μm厚のポリエチレン薄膜を2枚の不織布の間に流し込み、熱融着し一体化して貼付剤の支持体を得た。この支持体の透湿度を実施例1と同様に測定したところ、透湿度は1300g/㎡/24hrであった。

この支持体のレーヨン不織布側に実施例1と同様の含水性膏体を展延し、貼付剤(6cm×8cm)を得た。

実施例 3

トリコット織布にポリウレタン溶液を塗布、乾燥して貼付剤の支持体を得た。この支持体の透湿度を実施例1と同じ方法で測定したところ

実施例 1

第1表：含水性膏体組成

組 成	配合量(v/v%)
ポリアクリル酸	8.0
ポリアクリル酸ナトリウム	2.0
カルボキシメチルセルロース	2.0
ゼラチン	4.0
グリセリン	27.0
カオリン	8.0
β-メントール	1.0
サリチル酸グリコール	2.0
酢酸トコフェロール	0.3
d-β-カンフル	0.5
ポリソルベート80	1.0
水酸化カルシウム	0.2
カリ明パン	0.3
水	残量
合 計	100.0

1.5デニールのポリエステルウェブをニードルパンチして得た不織布(100g/㎡)にポリウレタン溶液を塗布、乾燥して貼付剤の支持体を得た。この支持体の透湿度を前述のJIS一般試験法により測定したところ、透湿度は2300g/㎡/24hrであった。

この支持体の上に第1表に示した含水性膏体

1800g/㎡/24hrであった。この支持体を実施例1と同様に含水性膏体を展延し、貼付剤(6cm×8cm)を作成した。

比較例 1

ポリエステル100%の不織布について実施例1と同じ方法で透湿度を測定したところ、透湿度は8500g/㎡/24hrであった。

この支持体を実施例1と同様に含水性膏体を展延し、貼付剤(6cm×8cm)を得た。

比較例 2

ポリエステル100%の不織布に厚さ30μmのポリエチレンフィルムを接着剤により一体化したもののについて、実施例1と同様の方法で透湿度を測定したところ、透湿度は35g/㎡/24hrであった。

この支持体を実施例1と同様に含水性膏体を展延し、貼付剤(6cm×8cm)を得た。

試験例 1

実施例1, 2, 3および比較例1, 2で製造した貼付剤を、うさぎ(体重2.3～2.8kg)の、背

部をバリカンにて除毛した後、貼付し、一定時間毎に血清中サリチル酸濃度を測定して、その結果を第2表に示した。

第2表：血清中サリチル酸濃度($\mu\text{g}/\text{ml}$) (n=10)

	実施例 1	実施例 2	実施例 3	比較例 1	比較例 2
1時間後	2.64	3.10	2.77	1.65	2.90
2時間後	3.37	3.76	3.10	2.09	3.63
4時間後	3.17	3.37	2.97	2.05	3.30
6時間後	3.23	3.10	2.90	1.91	2.97
8時間後	3.00	2.90	2.80	1.85	3.10
10時間後	3.17	2.77	2.57	1.65	2.90

試験例2

実施例1, 2, 3および比較例1, 2で製造した貼付剤を、健康男子20名の上腕部に貼付し、3時間経過後の粘着性(第3表)、剥離後のベタツキ(第4表)、皮膚刺激性(第5表)を評価し、以下の各表に示した。

(以下余白)

第3表：粘着性評価結果

(n=20)

	実施例 1	実施例 2	実施例 3	比較例 1	比較例 2
めくれなかった	16名	14名	17名	1名	15名
周囲がややめくれた	3	5	2	6	3
かなりめくれた	1	1	1	8	2
剥れ落ちた	0	0	0	5	0

(以下余白)

第4表：剥離後のベタツキ評価結果

(n=20)

	実施例 1	実施例 2	実施例 3	比較例 1	比較例 2
かなりベタツいた	0名	0名	0名	0名	17名
ベタツいた	1	2	0	1	3
ややベタツいた	2	2	3	2	0
ベタツかなかった	17	16	17	17	0

第5表：皮膚刺激性評価結果

(n=20)

	実施例 1	実施例 2	実施例 3	比較例 1	比較例 2
明らかな紅斑を認めた	0名	0名	0名	0名	1名
わずかな紅斑を認めた	0	0	0	0	2
極くわずかな紅斑を認めた	1	2	1	1	5
反応を認めなかった	19	18	19	19	12

実施例4~11

下記の第6表に示した組成の膏体を、支持体(透湿度は同表中に記載)に塗工して本発明の貼付剤を得た。

これら貼付剤は、いずれも実施例1と同様の優れた特性を示した。

(以下余白)

第6表	実施例	成分									
		4	5	6	7	8	9	10	11		
有効成分	サリチル酸グリコール	1.0	1.5	1.0	-	-	-	-	-	-	-
	サリチル酸メチル	0.5	-	-	-	-	-	-	-	-	-
	インドメタシン	-	-	-	0.5	-	-	-	-	-	-
	サトアロフェン	-	-	-	-	0.5	-	-	-	-	-
	イブプロフェン	-	-	-	-	-	-	0.3	-	-	5.0
	ジクロフェナクサトトリウム	-	-	-	-	-	-	-	2.5	-	-
	アフェキサマック	-	-	-	-	-	-	-	0.5	-	-
	塩酸ジフェニヒドラミン	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
	クロタミトン	-	-	-	3.0	3.0	-	-	-	-	-
	8-メチントール	1.0	-	1.0	1.0	1.0	1.0	0.5	1.0	-	-
水溶性高分子	ハッカ油	-	1.5	-	-	-	-	-	-	-	-
	ユーカリ油	-	0.5	-	-	-	-	0.5	-	-	-
	トウガラシエキス	-	0.2	-	-	-	-	-	-	-	-
	オオハクエキス	-	-	0.5	-	-	-	-	-	-	-
	酢酸トコフェロール	-	0.3	0.3	1.0	-	-	-	-	-	-
	ポリアクリル酸	5.0	6.0	-	4.0	4.0	8.0	3.0	1.0	-	-
	ポリアクリル酸ナトリウム	1.5	1.8	2.0	1.0	1.0	2.0	0.8	0.5	-	-
	セラチン	-	-	-	4.0	-	-	-	-	-	-
	カルボキシメチルセルロースナトリウム	4.0	3.0	3.0	4.0	3.5	2.0	3.0	4.0	-	-
	アルギン酸ナトリウム	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
薬物成分	ポリエチレンオキサライド	-	-	-	1.0	-	-	-	1.0	-	-
	カオリン	7.0	5.0	7.0	6.0	5.0	7.0	-	7.0	-	-
	酸化チタン	-	1.0	-	-	2.0	-	-	5.0	-	-
	炭酸アルミニウムカリウム	-	-	0.03	-	-	-	-	-	-	-
	水酸化アルミニウム	-	-	-	-	-	-	0.05	-	-	-
	水酸化ナトリウム	0.08	0.06	0.06	0.08	0.11	0.05	0.08	0.10	-	-
	ジヒドロキシアルミニウムアミノアセテート	-	0.03	-	0.03	0.03	-	-	0.03	-	-
	グリセリン	20.0	15.0	20.0	15.0	15.0	15.0	15.0	15.0	20.0	-
	プロピレングリコール	-	-	-	5.0	10.0	5.0	-	-	-	-
	ポリエチレングリコール400	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
界面活性剤	ソルビトール液(70%)	10.0	10.0	10.0	5.0	-	-	5.0	10.0	-	-
	ポリソルベート80	1.0	-	1.0	-	-	-	-	-	-	-
	P.O.E. 炭化ヒマジン油(60E,0)	-	1.0	-	-	-	-	1.0	-	-	-
	グリセリン脂肪酸エステル	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
	P.O.E. (40) モノステアレート	-	-	-	1.0	-	-	-	-	-	-
	P.O.E. (8) ラウリルエーテル	-	-	-	-	1.0	-	-	-	-	-
	セッケン類	-	-	0.13	-	-	-	-	-	-	-
	エチレンジアミン四酢酸ナトリウム	-	-	-	0.02	-	-	-	-	-	-
	その他	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
	用剤水	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
支持体	透過率(1/24hr)	1300	1300	1300	1300	1800	1800	1800	2300	-	-
		-	-	-	-	-	-	-	-	-	-

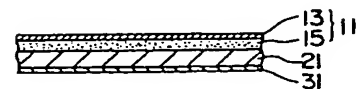
4. 図面の簡単な説明

第1図および第2図は、本発明の貼付剤の構成例の層構成を示す断面図である。

- 11…支持体 13,13'…高分子フィルム
15,17…不織布 21…含水性膏体層
31…ライナー

特許出願人 ライオン株式会社
代理人 井理士 白 村 文 男

第 1 図



第 2 図

